



Dr. Josué Alejandro Roblero Díaz

Dr. Dagoberto Silvestre Esteban

Tabla de los Principales Receptores fisiológicos.

Farmacología

PASIÓN POR EDUCAR

3°

A

Comitán de Domínguez Chiapas a 13 de marzo de 2024.



RECEPTORES FISIOLÓGICOS.



RECEPTOR	LOCALIZACIÓN	CARACTERÍSTICAS	PROCESO	FISIOLÓGICO
<p>Receptores intracelulares</p>	<p>pueden estar en: Citoplasma Núcleo</p>	<ul style="list-style-type: none"> • Dominio de unión a ligando • Dominio de unión al ADN • Dominio que interactúa con otros factores de transcripción (e.g., coactivadores, inhibidores) 	<ul style="list-style-type: none"> • Receptores nucleares de hormonas esteroideas • Receptor de vitamina D • Guanilato ciclasa (el receptor de óxido nítrico que funciona como una enzima, • generando guanosín monofosfato cíclico) 	<p>Los receptores intracelulares pueden estar ubicados dentro del citoplasma o del núcleo. Los receptores ubicados dentro del citoplasma se mueven hacia el núcleo una vez que se unen con su ligando (i.e., hormona). Dentro del núcleo, el complejo hormona-receptor se une a los elementos de respuesta hormonal, que son secuencias específicas de ADN. El complejo luego se une a otros factores de transcripción para alterar la expresión génica.</p>
<p>Receptores de superficie celular (receptores transmembran)</p>	<p>Situados dentro de la membrana plasmática</p>	<ul style="list-style-type: none"> • Dominio de unión a ligando extracelular • Dominio hidrofóbico dentro de la membrana plasmática • Dominio intracelular 	<p>Subtipos de receptores de superficie celular:</p> <ul style="list-style-type: none"> • Receptores de canales iónicos activados por ligando (activados químicamente) • Receptores acoplados a proteína G • Receptores ligados a enzimas (tipo más común: receptores tirosina quinasa) 	<p>Los ligandos que utilizan receptores transmembrana normalmente no pueden atravesar la propia membrana porque son hidrófilos y/o grandes.</p> <p>El dominio intracelular comunica la señal dentro de la célula a través de:</p> <p>Modificación covalente de otras moléculas: Generación de 2do mensajero, siendo los más comunes:</p> <ul style="list-style-type: none"> • Adenosín monofosfato cíclico • Guanosín monofosfato cíclico • Trifosfato de inositol • Diacilglicerol • Iones de calcio (Ca²⁺)



RECEPTORES FISIOLÓGICOS.



RECEPTOR

LOCALIZACIÓN

CARACTERÍSTICAS

TIPOS

FISIOLÓGICO

Receptores Ligados a Enzimas

Receptores que tienen algún tipo de actividad enzimática cuando son "activados" por su ligando
 Frecuentemente quinasas: enzimas que catalizan la transferencia de un grupo fosfato de 1 molécula a otra
 Tirocinaquinasas: Tipo más común
 Se han identificado más de 90 genes que codifican para receptores tirocina quinasas
 Serina-treonina quinasas

Estructura del receptor tirocina quinasas

- Dominio extracelular que contiene el sitio de unión al ligando
- Dominio de quinasas intracelular
- Hélice transmembrana única que une componentes extracelulares e intracelulares

La estructura de 3 partes del receptor tirocina quinasas se muestra junto con los ligandos que se unen a sus sitios de unión extracelulares.

Receptor de tirocina quinasas

Receptores de insulina

- Subunidades **alfa**: dominios extracelulares que contienen el sitio de unión al ligando
- Subunidades **beta**: dominios de tirocina quinasas transmembrana e intracelular

Función del receptor tirocina quinasas:

Cuando un ligando se une al dominio extracelular del receptor tirocina quinasas, 2 receptores tirocina quinasas se unen en un proceso conocido como dimerización. Una vez dimerizado, cada uno de los monómeros transfiere un grupo fosfato del adenosín trifosfato (ATP) a su compañero en un proceso conocido como autofosforilación. Después de la autofosforilación, las fosfotirosinas actúan como sitios de acoplamiento y activación para otras proteínas, que suelen ser otras enzimas. El tipo de respuesta celular depende de qué proteínas adicionales estén presentes.

Receptores de Canales Iónicos Activados por Ligandos

Los receptores de canales iónicos activados por ligandos (activados químicamente) son un subtipo de receptores de superficie celular.

- Constan de múltiples subunidades transmembrana alrededor de un canal central conductor de iones
- Tienen un sitio de unión al ligando extracelular (o intracelular)

- la unión de un ligando con un receptor de canal iónico activado por ligando, lo que provoca un cambio de conformación en el canal, lo que permite el paso de iones.

- El ligando (ej: acetilcolina) se une al receptor del canal iónico. Induce un cambio conformacional → se abre el canal
 - Los iones fluyen siguiendo su gradiente electroquímico a través de los canales (e.g., Na⁺, K⁺, Ca²⁺ y/o Cl⁻).
- Esto puede resultar en:
- Transmisión de señales nerviosas de contracción muscular
 - Liberación de hormonas
 - Activación de células T.
 - Cuando el ligando se disocia el canal se cierra.



RECEPTORES FISIOLÓGICOS.



RECEPTOR	LOCALIZACIÓN	CARACTERÍSTICAS	TIPOS DE EFECTO FISIOLÓGICO
Receptores Acoplados a Proteína G	<p>Los receptores acoplados a proteína G son proteínas transmembrana que se unen a ligandos hormonales en su lado extracelular, lo que induce un cambio conformacional dentro de la célula, activando una proteína G asociada, que luego desencadena una cascada de señalización a través de 2dos mensajeros.</p>	<p>Las proteínas G constan de 3 subunidades: alfa (que se une al guanosín difosfato (GDP) en su forma inactiva y al guanosín trifosfato (GTP) en su forma activa), beta y gamma (que ayuda a la subunidad alfa a asociarse con el GPCR).</p>	<p>Vía de activación de los receptores acoplados a proteína G:</p> <p>Un ligando se une al receptor acoplado a proteína G, induciendo un cambio conformacional interno. Este cambio conformacional hace que la subunidad alfa de la proteína G intercambie un guanosín difosfato (GDP) por un guanosín trifosfato (GTP), que activa la proteína G.</p> <p>La subunidad alfa unida a GTP se separa de las subunidades beta y gamma activa una enzima efectora (a través de la fosforilación del GTP).</p> <p>La enzima efectora luego activa un 2do mensajero (aquí, el adenosín monofosfato cíclico (cAMP)), que transmite la señal dentro de la célula.</p>
Receptores Nucleares	<p>Es un subtipo de receptor intracelular Actúan como factores de transcripción activados por ligandos, que finalmente afectan la expresión génica Aunque se conocen como receptores nucleares, a menudo se encuentran en el citoplasma, y se mueven hacia el núcleo</p>	<p>Región de unión al ligando C terminal</p> <p>Ya que son el dominio de unión al ADN central, que se une a los elementos de respuesta hormonal en el ADN</p> <p>Regiones que interactúan con otros factores de transcripción</p>	<p>Vía de activación :</p> <p>El ligando se une al receptor intracelular (generalmente en el citoplasma).</p> <p>El complejo ligando-receptor viaja al núcleo (si aún no está allí) para unirse a los elementos de respuesta hormonal en el ADN. Interactúa con otros factores de transcripción para afectar la expresión génica (pueden actuar como potenciadores o inhibidores)</p>



Conclusión

Se dice que un receptor es una macromolécula celular con la cual se liga a través de un fármaco para iniciar sus efectos; dentro que cabe es un grupo importante ya que estos receptores están compuestos por proteínas que normalmente actúan como receptores; ligandos, endógenos y corrientes que son como ejemplo las hormonas, los factores de crecimiento y los neurotransmisores.

Los receptores son macromoléculas cuya función es reconocer y fijar moléculas que provienen del exterior de la célula. Pueden estar situados en la membrana plasmática o en el interior de la célula.

Por ello en este este trabajo realizado a través de tablas se menciona sus características, tipos y funciones fisiológicas que tiene de cada receptor.

Bibliografía

Laurence, B. L. (2023). *Goodman & Gilman. Las Bases Farmacológicas de la Terapéutica*. McGraw-Hill.

